

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



11 FEB 2005

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
27. Januar 2005 (27.01.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/007650 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D 405/12,
311/72, A61K 31/355, A61P 29/00

Manfred [AT/AT]; Rankengasse 28, A-8020 Graz
(AT). MATUSZCZAK, Barbara [AT/AT]; Her-
zog-Friedrich-Strasse 11, A-6020 Innsbruck (AT).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/AT2004/000234

(74) Anwalt: BEER, Manfred; Lindengasse 8, A-1070 Wien
(AT).

(22) Internationales Anmeldedatum:
1. Juli 2004 (01.07.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
A 1127/2003 17. Juli 2003 (17.07.2003) AT

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme
von US): JSW-RESEARCH FORSCHUNGS LABOR
GMBH [AT/AT]; Rankengasse 28, A-8020 Graz (AT).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,
AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,
FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,
MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG,
PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM,
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM,
ZW.

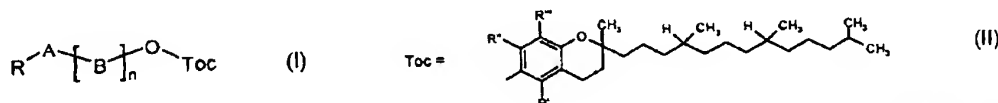
(72) Erfinder; und
(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): WINDISCH,

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: CHEMICAL COMPOUNDS CONTAINING TOCOPHEROL AND AT LEAST ONE ADDITIONAL PHARMACEU-
TICAL ACTIVE SUBSTANCE

(54) Bezeichnung: CHEMISCHE VERBINDUNGEN ENTHALTEND TOCOPHEROL SOWIE ZUMINDEST EINEN WEITE-
REN PHARMAZEUTISCHEN WIRKSTOFF



(57) Abstract: The invention relates to chemical compounds in the form of racemates, enantiomers and/or diastereomers of general formula (I), wherein R represents the non-modified part of a variable pharmaceutical active substance molecule, B represents a spacer and Toc and corresponds to formula (II), R', R'' and R''' are H or methyl for tocopherol and A is C=X, SO_m, X and/or CH₂. X is O, S or NR¹ (n = 1) and/or S or NR¹ (n = 0) and B is a group X-R² y, wherein Y is C=X, SO_m or C (XR³) R⁴, and n is 0 - 6, preferably 0, 1, 2 or 3 and m represents 1 or 2. R¹ represents H, C₁ - C₁₀-alkyl, preferably C₁ - C₆-alkyl and/or aryl, Het or an aryl radical and/or a Het radical connected via a C₁ - C₆ spacer, preferably C₁ - C₃ and R² is selected from the group containing alkene, arylene and/or Het spacer and combinations thereof and can be combined directly with each other or via the A radical and/or via the group X₀-A-X_p, wherein o and p can be equal or different and are 0, 1 or 2, and R³ and R⁴ represent H, C₁ - C₁₀ alkyl, preferably C₁-C₆-alkyl and/or aryl, Het or an aryl radical and/or a Het radical bound by means of a C₁ - C₆, preferably C₁ - C₃ spacer.

WO 2005/007650 A1

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft chemische Verbindungen in Form ihrer Racemate, Enantiomere bzw. Diastereomere mit der allgemeinen Formel (I) worin R für den unveränderten Teil eines variablen pharmazeutischen Wirkstoffmoleküls, B für einen Spacer und Toc mit der Formel (II) und R', R'' und R''' gleich H oder Methyl für Tocopherol sowie A für C=X, SO_m, X bzw. CH₂ stehen, wobei X gleich O, S oder NR¹ (bei n ≥ 1) bzw. S oder NR¹ (bei n = 0) und B eine Gruppierung X-R² - y mit Y gleich C=X, SO_m oder C (XR³) R⁴ bedeuten und n gleich 0 bis 6, vorzugsweise 0, 1, 2 oder 3 ist und m für 1 oder 2 steht, wobei R¹ für H, C₁ bis C₁₀-Alkyl, vorzugsweise C₁ bis C₆-Alkyl bzw. Aryl, Het oder einen über einen C₁ bis C₆-Spacer, vorzugsweise C₁ bis C₃ gebundenen Aryl- bzw. Het-Rest steht und wobei R² aus der Gruppe Alkylen-, Arylen- bzw. Het-Spacer sowie Kombinationen daraus ausgewählt ist, wobei diese entweder direkt oder über den Rest A bzw. über die Gruppierung X₀-A-X_p miteinander verknüpft sind, wobei o und p gleich 0, 1 oder 2 sind und diese gleich oder verschieden sein können, und wobei R³ und R⁴ für H, C₁ bis C₁₀ Alkyl, vorzugsweise C₁-C₆-Alkyl bzw. Aryl, Het oder einen über einen C₁ bis C₆ vorzugsweise C₁ bis C₃-Spacer gebundenen Aryl- bzw. Het-Rest stehen.



ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

— vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.